

⑯ 公開特許公報 (A) 昭61-87695

⑤ Int.Cl.¹

識別記号

庁内整理番号

⑯ 公開 昭和61年(1986)5月6日

C 07 K 7/20

6464-4H

A 61 K 37/24

AEE

7138-4C

// C 07 K 99:54

6464-4H 審査請求 未請求 発明の数 1 (全13頁)

⑦ 発明の名称 GnRH拮抗物質

⑧ 特願 昭60-197532

⑨ 出願 昭60(1985)9月6日

優先権主張

⑩ 1984年9月7日 ⑪ 米国(US) ⑫ 648637

⑬ 発明者 ワイリー・ウォーカー アメリカ合衆国カリフォルニア州92037, ラ・ホーラ, パー・ペール・ジュニア ルデズ 1643

⑭ 発明者 ジヤン・エドワール・フレデリック・リバー アメリカ合衆国カリフォルニア州92037, ラ・ホーラ, ブラックゴールド・ロード 9674 ル

⑮ 出願人 ザ・サルク・インステチュート・フォー・バイオロジカル・スタディーズ イーズ アメリカ合衆国カリフォルニア州ラ・ホーラ, ノース・トレイン・バインズ・ロード 10010

⑯ 代理人 弁理士 湯浅 恒三 外5名

明細書

1. [発明の名称]

GnRH拮抗物質

2. [特許請求の範囲]

① 次式:

$$X-R_1-(W)D-Phe-R_3-R_4-R_5-R_6(V)-R_7-Arg-Pro-R_{10}$$

[式中、Xは水素原子または7個以下の炭素原子を有するアシル基であり；

R₁はデヒドロ-Pro, Pro, D-pGlu, D-Phe,

D-Trp または β -D-NAL であり；

WはF, Cl, Cl₂, Br, NO₂ または C²Me-CI

であり；

R₃はD-Trp, (NⁱⁿFor)D-Trp または NO₂, NH₂, OCH₃, F, Cl, Br または CH₃で5位または6位が置換されたD-Trp であり；

R₄はSer, Orn, AAL または α Bu であり；

R₅はTyr, (3F)Phe, (2F)Phe, (3I)Tyr,

(3CH₃)Phe, (2CH₃)Phe, (3Cl)Phe または (2Cl)Phe であり；

R₆はD-Lys, D-Orn または D-Dap であり；

Vは(Arg-R¹, R²)_n(X) であり、ただし nは1～5であり、R¹およびR²はH、メチル、エチル、プロピルまたはブチルであり；

R₇はLeu, NML, Nle または Nva であり；

そして

R₁₀はGly-NH₂, D-Ala-NH₂ または NH-Y であり、ただし Yは低級アルキル、シクロアルキル、フルオル低級アルキルまたはNH-COHN-Q (ここでQはHまたは低級アルキルである)である]

で表わされるペプチドまたはその無活性塩。

(2) R₃が(6NO₂)D-Trp であり、R₆がD-Lys である特許請求の範囲第1項記載のペプチド。

(3) R₁が β -D-2NAL である特許請求の範囲第1項または第2項記載のペプチド。

(4) VがArg₃(Ac) である特許請求の範囲第1～3項のいずれか1つに記載のペプチド。

(5) XがAc である特許請求の範囲第1～4項のいずれか1つに記載のペプチド。